


# VERTRAG ÜBER DIE INTERNATIONALE ZUSAMMENARBEIT AUF DEM GEBIET DES PATENTWESENS

## PCT

### INTERNATIONALER VORLÄUFIGER BERICHT ÜBER DIE PATENTIERBARKEIT

(Kapitel II des Vertrags über die internationale Zusammenarbeit auf dem Gebiet des Patentwesens)

Aktenzeichen des Anmelders oder Anwalts 0000055484-2	<b>WEITERES VORGEHEN</b> siehe Formblatt PCT/PEA/416	
Internationales Aktenzeichen PCT/EP2005/004187	Internationales Anmeldedatum (Tag/Monat/Jahr) 29.03.2005	Prioritätsdatum (Tag/Monat/Jahr) 30.03.2004
Internationale Patentklassifikation (IPC) oder nationale Klassifikation und IPC INV. C07D487/04 A01N43/90		
Anmelder BASF AKTIENGESELLSCHAFT		
<p>1. Bei diesem Bericht handelt es sich um den internationalen vorläufigen Prüfungsbericht, der von der mit der internationalen vorläufigen Prüfung beauftragten Behörde nach Artikel 35 erstellt wurde und dem Anmelder gemäß Artikel 36 übermittelt wird.</p> <p>2. Dieser BERICHT umfaßt insgesamt 10 Blätter einschließlich dieses Deckblatts.</p> <p>3. Außerdem liegen dem Bericht ANLAGEN bei; diese umfassen</p> <p>a. <input type="checkbox"/> (an den Anmelder und das Internationale Büro gesandt) insgesamt Blätter; dabei handelt es sich um</p> <p><input type="checkbox"/> Blätter mit der Beschreibung, Ansprüchen und/oder Zeichnungen, die geändert wurden und diesem Bericht zugrunde liegen, und/oder Blätter mit Berichtigungen, denen die Behörde zugestimmt hat (siehe Regel 70.16 und Abschnitt 607 der Verwaltungsvorschriften).</p> <p><input type="checkbox"/> Blätter, die frühere Blätter ersetzen, die aber aus den in Feld Nr. 1, Punkt 4 und im Zusatzfeld angegebenen Gründen nach Auffassung der Behörde eine Änderung enthalten, die über den Offenbarungsgehalt der internationalen Anmeldung in der ursprünglich eingereichten Fassung hinausgeht.</p> <p>b. <input type="checkbox"/> (nur an das Internationale Büro gesandt) insgesamt (bitte Art und Anzahl der/des elektronischen Datenträger(s) angeben), der/die ein Sequenzprotokoll und/oder die dazugehörigen Tabellen enthält/enthalten, nur in elektronischer Form, wie im Zusatzfeld betreffend das Sequenzprotokoll angegeben (siehe Abschnitt 802 der Verwaltungsvorschriften).</p> <p>4. Dieser Bericht enthält Angaben zu folgenden Punkten:</p> <p><input checked="" type="checkbox"/> Feld Nr. I Grundlage des Berichts</p> <p><input type="checkbox"/> Feld Nr. II Priorität</p> <p><input type="checkbox"/> Feld Nr. III Keine Erstellung eines Gutachtens über Neuheit, erfinderische Tätigkeit und gewerbliche Anwendbarkeit</p> <p><input checked="" type="checkbox"/> Feld Nr. IV Mangelnde Einheitlichkeit der Erfindung</p> <p><input checked="" type="checkbox"/> Feld Nr. V Begründete Feststellung nach Artikel 35(2) hinsichtlich der Neuheit, der erfinderischen Tätigkeit und der gewerblichen Anwendbarkeit; Unterlagen und Erklärungen zur Stützung dieser Feststellung</p> <p><input type="checkbox"/> Feld Nr. VI Bestimmte angeführte Unterlagen</p> <p><input checked="" type="checkbox"/> Feld Nr. VII Bestimmte Mängel der internationalen Anmeldung</p> <p><input type="checkbox"/> Feld Nr. VIII Bestimmte Bemerkungen zur internationalen Anmeldung</p>		
Datum der Einreichung des Antrags  26.01.2006	Datum der Fertigstellung dieses Berichts  10.04.2006	
Name und Postanschrift der mit der internationalen vorläufigen Prüfung beauftragten Behörde   Europäisches Patentamt D-80298 München Tel. +49 89 2399 - 0 Tx: 523656 epmu d Fax: +49 89 2399 - 4465	Bevollmächtigter Bediensteter  Stroeter, T  Tel. +49 89 2399-8088	



---

**Feld Nr. I Grundlage des Berichts**

---

1. Hinsichtlich der **Sprache** beruht der Bericht auf der internationalen Anmeldung in der Sprache, in der sie eingereicht wurde, sofern unter diesem Punkt nichts anderes angegeben ist.
- ☐ Der Bericht beruht auf einer Übersetzung aus der Originalsprache in die folgende Sprache, bei der es sich um die Sprache der Übersetzung handelt, die für folgenden Zweck eingereicht worden ist:
- ☐ internationale Recherche (nach Regeln 12.3 und 23.1 b))
  - ☐ Veröffentlichung der internationalen Anmeldung (nach Regel 12.4)
  - ☐ internationale vorläufige Prüfung (nach Regeln 55.2 und/oder 55.3)
2. Hinsichtlich der **Bestandteile**\* der internationalen Anmeldung beruht der Bericht auf *(Ersatzblätter, die dem Anmeldeamt auf eine Aufforderung nach Artikel 14 hin vorgelegt wurden, gelten im Rahmen dieses Berichts als "ursprünglich eingereicht" und sind ihm nicht beigelegt)*:

**Beschreibung, Seiten**

1-26 in der ursprünglich eingereichten Fassung

**Ansprüche, Nr.**

1-18 in der ursprünglich eingereichten Fassung

☐ einem Sequenzprotokoll und/oder etwaigen dazugehörigen Tabellen - siehe Zusatzfeld betreffend das Sequenzprotokoll

3. ☐ Aufgrund der Änderungen sind folgende Unterlagen fortgefallen:
- ☐ Beschreibung: Seite
  - ☐ Ansprüche: Nr.
  - ☐ Zeichnungen: Blatt/Abb.
  - ☐ Sequenzprotokoll (*genaue Angaben*):
  - ☐ etwaige zum Sequenzprotokoll gehörende Tabellen (*genaue Angaben*):
4. ☐ Dieser Bericht ist ohne Berücksichtigung (von einigen) der diesem Bericht beigelegten und nachstehend aufgelisteten Änderungen erstellt worden, da diese aus den im Zusatzfeld angegebenen Gründen nach Auffassung der Behörde über den Offenbarungsgehalt in der ursprünglich eingereichten Fassung hinausgehen (Regel 70.2 c)).
- ☐ Beschreibung: Seite
  - ☐ Ansprüche: Nr.
  - ☐ Zeichnungen: Blatt/Abb.
  - ☐ Sequenzprotokoll (*genaue Angaben*):
  - ☐ etwaige zum Sequenzprotokoll gehörende Tabellen (*genaue Angaben*):

\* Wenn Punkt 4 zutrifft, können einige oder alle dieser Blätter mit der Bemerkung "ersetzt" versehen werden.

**INTERNATIONALER VORLÄUFIGER BERICHT  
ÜBER DIE PATENTIERBARKEIT**

Internationales Aktenzeichen  
PCT/EP2005/004187

---

**Feld Nr. IV Mangelnde Einheitlichkeit der Erfindung**

---

1. ☒ Auf die Aufforderung zur Einschränkung der Ansprüche oder zur Zahlung zusätzlicher Gebühren hat der Anmelder:
- ☐ die Ansprüche eingeschränkt.
  - ☒ zusätzliche Gebühren entrichtet.
  - ☐ zusätzliche Gebühren unter Widerspruch entrichtet.
  - ☐ weder die Ansprüche eingeschränkt noch zusätzliche Gebühren entrichtet.
2. ☐ Die Behörde hat festgestellt, daß das Erfordernis der Einheitlichkeit der Erfindung nicht erfüllt ist, und hat gemäß Regel 68.1 beschlossen, den Anmelder nicht zur Einschränkung der Ansprüche oder zur Zahlung zusätzlicher Gebühren aufzufordern.
3. Die Behörde ist der Auffassung, daß das Erfordernis der Einheitlichkeit der Erfindung nach den Regeln 13.1, 13.2 und 13.3
- ☐ erfüllt ist.
  - ☒ aus folgenden Gründen nicht erfüllt ist:  
**siehe Beiblatt**
4. Daher ist der Bericht für die folgenden Teile der internationalen Anmeldung erstellt worden:
- ☐ alle Teile.
  - ☒ die Teile, die sich auf die Ansprüche mit folgenden Nummern beziehen: 1, 2, 4, 5, 9, 10, 12, 14, 16-18 (teilweise); 13 (ganz) .

---

**Feld Nr. V Begründete Feststellung nach Artikel 35 (2) hinsichtlich der Neuheit, der erfinderischen Tätigkeit und der gewerblichen Anwendbarkeit; Unterlagen und Erklärungen zur Stützung dieser Feststellung**

---

1. Feststellung
- |                                |  |
|--------------------------------|--|
| Neuheit (N)                    | Ja: Ansprüche 1, 2, 4, 5, 9, 10, 12-14, 16-18  |
|                                | Nein: Ansprüche                                |
| Erfinderische Tätigkeit (IS)   | Ja: Ansprüche 1, 2, 4, 5, 9, 10, 12-14, 16-18  |
|                                | Nein: Ansprüche                                |
| Gewerbliche Anwendbarkeit (IA) | Ja: Ansprüche: 1, 2, 4, 5, 9, 10, 12-14, 16-18 |
|                                | Nein: Ansprüche:                               |
2. Unterlagen und Erklärungen (Regel 70.7):  
**siehe Beiblatt**

**INTERNATIONALER VORLÄUFIGER BERICHT  
ÜBER DIE PATENTIERBARKEIT**

Internationales Aktenzeichen  
PCT/EP2005/004187

---

**Feld Nr. VII Bestimmte Mängel der internationalen Anmeldung**

---

Es wurde festgestellt, daß die internationale Anmeldung nach Form oder Inhalt folgende Mängel aufweist:

**siehe Beiblatt**

**Zu Punkt IV**

**Mangelnde Einheitlichkeit der Erfindung**

Die vorliegende Anmeldung ist nicht einheitlich gemäß den Bestimmungen des der Regel 13.1 und 13.2 PCT. Die verschiedenen Gruppen von Erfindungen sind:

- (1) Ansprüche 1, 2, 4, 5, 9, 10, 12, 14, 16-18 (teilweise)  
Verbindungen der Formel I worin X= Alkyl und R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup> = H, Alkyl, Halogenalkyl, Cycloalkyl, Halogenycycloalkyl, Alkenyl, Halogenalkenyl, Cycloalkenyl, Halogenycycloalkenyl, Alkynyl, Halogenalkynyl, Phenyl, Naphthyl, ungesättigter bzw. aromatischer Heterocyclus bzw. Verbindungen der Formel I.1, I.2 und I.4
- (2) Ansprüche 1-3, 7, 12, 14, 16-18 (teilweise)  
Verbindungen der Formel I worin X= Alkyl und R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup> und 7-N-Atom Heteroring bildet, welcher verschieden von Piperidin bzw. von Methyl-substituierten Piperidinen ist bzw. Verbindungen der Formel I.3
- (3) Ansprüche 1-11, 15-18 (teilweise)  
Verbindungen der Formeln I, I.1, I.2, I.3 und I.4 worin X = CN
- (4) Ansprüche 1-11, 15-18 (teilweise)  
Verbindungen der Formeln I, I.1, I.2, I.3 und I.4 worin X = Alkoxy, Halogenalkoxy, Alkenyloxy, Halogenalkenyloxy
- (5) Anspruch 13 (ganz)  
Bestimmte Intermediate der Formel (IV) und (V)

Die Gründe für diese Feststellung sind folgende:

1. Gruppen (1) bis (4)

Diese Erfindungsgruppen der vorliegenden Anmeldung offenbaren fungizide in 5-Position substituierte 6-(2,6-dichlorophenyl)-7-aminotriazolopyrimidine. Die beanspruchten Verbindungen der vorliegenden Anmeldung beinhalten also als gemeinsames Strukturmerkmal ein Triazolopyrimidinsystem, welches in 5-Position substituiert ist, in 6-

Position durch 2,6-Dichlorophenyl substituiert ist und in 7-Position durch ein Aminogruppe substituiert ist. Verbindungen mit solchen strukturellen Merkmalen gehören aber bereits zum Stand der Technik (D1: FR-2765875, Bsp. 8 und D2: US-5994360, Bsp. 8, D3: WO02/38565 I-7,8,9 mit chiralen Alkylsubstituenten).

Das technische Problem ausgehend von D1, D2 besteht in der Bereitstellung weiterer fungizider Triazolopyrimidine. Die von den vorliegenden Ansprüchen umfaßten Verbindungen wurden dabei durch die folgenden Modifizierungen bekannter Verbindungen erhalten und resultieren somit aus unterschiedlichen möglichen Beiträgen zum Stand der Technik:

- re (1): Modifizierung der 7-Piperidinyl bzw. 7-(Methyl)piperidinyl-Verbindungen aus D1, D2 durch Ersatz des Piperidinringes wie in Bsp. 8 von D1, D2 mit zwei getrennten Substituenten.  
Anmerkung: Diese Gruppe ist in sich nicht einheitlich!
- re (2): Modifizierung von 7-Piperidinyl bzw. 7-(Methyl)piperidinyl in den Verbindungen aus D1, D2 durch Einführung anderer Heteroringe (z.B. pyrrolidinyl statt piperidinyl, Bsp. 2, 3 in D1).  
Anmerkung: Diese Gruppe ist in sich nicht einheitlich!
- re (3): Modifizierung der Verbindungen aus D1, D2 durch Einführung eines anderen Substituenten CN (statt Alkyl) in 5-Position
- re (4): Modifizierung der Verbindungen aus D1, D2 durch Einführung eines anderen Substituenten des Typs Alk(en)yloxy (statt Alkyl) in 5-Position

Diese Beiträge haben nicht mehr miteinander gemeinsam als jeder einzelne dieser Beiträge mit dem genannten Stand der Technik gemeinsam hat, d.h. ausgehend von D1 bzw. D2 teilen sich die Beiträge zum Stand der Technik auf 4 verschiedene Richtungen auf, welche keinem gemeinsamen erfinderischen Konzept unterzuordnen sind.

## 2. Gruppe (5):

Diese Erfindungsgruppe umfaßt Intermediate der Formeln IV und V welche zur Darstellung

der Verbindungen der Formel I benötigt werden. Intermediate gelten nur dann als mit den Produkten einheitlich, wenn sie bereits über das Strukturmerkmal verfügen, das die Produkte vom Stand der Technik abhebt. Diese Bedingung ist aber im vorliegenden Fall nicht erfüllt, da es sich um einige 5-Methyl-6-(2,6-dichlorphenyl)-7-OH - bzw. 7-halotriazolopyrimidine handelt und der 5-Methyl-6-(2,6-dichlorphenyl)-triazolopyrimidin-Teil dieser Verbindungen bereits bekannt ist (strenggenommen ist diese Gruppe daher auch in sich uneinheitlich), wohingegen das mögliche unterscheidende Merkmal der Produkte aber in der 7-Substitution liegt.

Dementsprechend ließen sich aus den Intermediaten der Formeln (IV) bzw. (V) Produkte herstellen, die in den Anspruchsbereich von D1, D2 fallen und somit nicht ausschließlich der Herstellung der vorliegenden modifizierten Verbindungen dienen.

Zwischen den Verbindungen aus dieser Gruppe und dem verbleibenden Gegenstand der Anmeldung ist somit kein verbindendes erfinderisches Konzept erkennbar.

Fazit: Demnach fehlt also für alle genannten Gruppen ein gemeinsames erfinderisches Konzept (Regel 13.1 PCT) bzw. ein gemeinsames "besonderes technisches Merkmal" (Regel 13.2 PCT) und entsprechend resultiert ein Uneinheitlichkeit des beanspruchten Gegenstandes.

### **Zu Punkt V**

#### **Begründete Feststellung hinsichtlich der Neuheit, der erfinderischen Tätigkeit und der gewerblichen Anwendbarkeit; Unterlagen und Erklärungen zur Stützung dieser Feststellung**

- 1 Die vorliegende Anmeldung befaßt sich mit der Bereitstellung von in 5-Position mit Alkyl, CN oder Alk(en)yoxy substituierten 6-(2,6-dichlorphenyl)-7-aminotriazolopyrimidinen, welche als Fungizide gegen Schadpilze einsetzbar sind. Beansprucht werden einige dieser Verbindungen (unabhängige Ansprüche 1, 4, 5, 7 und 9), Verfahren zu ihrer Herstellung (unabhängige Ansprüche 12, 14 und 15) mit dazugehörigen Zwischenstufen (unabhängiger Anspruch 13) sowie Mittel und Saatgut welche diese Verbindungen enthalten unabhängige Ansprüche 16 und 17) sowie Verfahren zur Bekämpfung von Schadpilzen (unabhängiger Anspruch 18)

welche die besagten Verbindungen enthalten bzw. anwenden.

- 2 **Die folgenden Ausführungen beziehen sich nur auf den Teil der Anmeldung, welcher recherchiert wurde, d.h. Gruppe (1): Ansprüche 1, 2, 4, 5, 9, 10, 12, 14, 16-18 (teilweise) und Gruppe (5): Anspruch 13 (ganz).**
- 3 Es wird auf die folgenden Dokumente verwiesen. Die angegebene Numerierung der Dokumente wird auch im weiteren Verfahren beibehalten:
  - D1: FR-A-2 765 875 (AMERICAN CYANAMID COMPANY) 15. Januar 1999
  - D2: US-A-5 994 360 (PFRENGLE ET AL) 30. November 1999
  - D3: WO 02/38565 A (BASF AKTIENGESELLSCHAFT; TORMO I BLASCO, JORDI; DITRICH, KLAUS; SAUTER) 16. Mai 2002
  - D4: WO 02/083677 A (BASF AKTIENGESELLSCHAFT; TORMO I BLASCO, JORDI; SAUTER, HUBERT; MUELLE) 24. Oktober 2002
  - D5: PATENT ABSTRACTS OF JAPAN Bd. 2003, Nr. 02, 5. Februar 2003 & JP 2002 308879 A (NIPPON SODA CO LTD), 23. Oktober 2002
- 4.1 Die vorliegenden Ansprüche der Gruppe (1) sind neu im Sinne des Artikels 33(2) PCT: Obwohl die Bereiche der Ansprüche aus D1-D3 mit der vorliegenden Formel I überlappen, werden diese Dokumente nicht als neuheitsschädlich angesehen, da im Überlappungsbereich keine spezifischen Beispiele offenbart sind, d.h. daß keine der Beispiel-Verbindungen aus D1, D2 und D4 sowohl über eine Alkylgruppe in 5-Position, eine Dichlorphenylgruppe in 6-Position als auch über eine acylische Aminogruppe in 7-Position verfügt. Die Verbindungen aus D4 zeigen eine Fluorchlorphenylgruppe statt der Dichlorphenylgruppe.
- 4.2 Der Anspruch der Gruppe (5) ist neu, da die strukturell naheliegendsten Verbindungen aus D5 keine 2,6-Dichlorphenylgruppe, sondern eine 2-Chlor-6-Fluorphenylgruppe aufweisen.
- 5.1 Ausgehend von D1 besteht das zu lösende technische Problem der vorliegenden Anmeldung in der Bereitstellung weiterer fungizider 5-Alkyl-6-(halophenyl)-7-aminotriazolopyrimidine. Die Lösung besteht in der Auswahl bestimmter



Verbindungen aus dem Bereich des Ansprüchen 1-4 aus D1 durch ein Substitutionsmuster am Triazolopyrimidinsystem in dem die 5-Position Alkyl-substituiert ist, die 6-Position durch 2,6-Dichlorophenyl substituiert ist und die 7-Position durch eine acyclische Aminogruppe substituiert ist. Eine solche Auswahl kann als erfinderisch gesehen werden, da der Anmelder durch Vergleich mit der strukturell naheliegendsten fungiziden Verbindung (Bsp. 8 aus D1 zeigt das vorliegende Substitutionsmuster mit der Ausnahme, daß hier das 7-N-Atom in ein cyclisches System eingebunden ist) eine verbesserte fungizide Wirkung gegen Befall an Weizenbraunrost bzw. Krautfäule bei *Puccinia recondita* und *Phytophthora infestans* nachgewiesen hat. Eine solche verbesserte Wirkung ist überraschend und somit kann die Bereitstellung der vorliegenden 5-Alkyl-6-(2,6-dichlorophenyl)-7-aminotriazolopyrimidine als erfinderischer Beitrag zum Stand der Technik gewertet werden. Daher sind die vorliegenden Ansprüche der Gruppe (1) erfinderisch im Sinne des Artikels 33(3) PCT.

5.2 Die vorliegenden Intermediate des Anspruchs 13 sind den Intermediaten aus D5 strukturell sehr ähnlich und dienen gleichermassen zur Darstellung 7-Amino-substituierter Triazolopyrimidine (siehe Absätze [0089] bis [0096]). Die beanspruchten Verbindungen sind als erfinderisch anzusehen, da sie zu erfinderischen Produkten (siehe 5.1) führen.

6 Die vorliegenden Ansprüche sind gewerblich anwendbar und erfüllen die Erfordernisse des Art. 33(4) PCT

### **Zu Punkt VII**

#### **Bestimmte Mängel der internationalen Anmeldung**

(1) Die relevanten Dokumente D1 und D2 sind nicht in der vorliegenden Anmeldung zitiert.

(2) Die Verbindungen aus den Ansprüchen 4, 5, 7 und 9 scheinen in den Anspruchsbereich des Anspruchs 1 zu fallen, demnach wären diese Ansprüche als von

**INTERNATIONALER VORLÄUFIGER  
BERICHT ZUR PATENTIERBARKEIT  
(BEIBLATT)**

Internationales Aktenzeichen

PCT/EP2005/004187

---

Anspruch 1 abhängig zu formulieren.